特 許 協 力 条 約

PCT

国際予備審査報告

(法第１２条、法施行規則第56条)
〔ＰＣＴ３６条及びＰＣＴ規則70〕

REC'D 22 JUL 2004
WIPO PCT

08 APR 2005

出願人又は代理人の書類記号　６６３９９１	今後の手続きについては、国際予備審査報告の送付通知（様式ＰＣＴ／ＩＰＥＡ／４１６）を参照すること。	
国際出願番号 ＰＣＴ／ＪＰ０３／１３１５２	国際出願日 (日.月.年)　１５．１０．２００３	優先日 (日.月.年)　１６．１０．２００２
国際特許分類（ＩＰＣ） Ｉｎｔ．Ｃｌ⁷　Ａ６１Ｋ３１／４４３９，４７／０２，９／１６，９／２８，９／４８，Ａ６１Ｐ１／０４		
出願人（氏名又は名称） 武田薬品工業株式会社		

１．　国際予備審査機関が作成したこの国際予備審査報告を法施行規則第57条（ＰＣＴ３６条）の規定に従い送付する。

２．　この国際予備審査報告は、この表紙を含めて全部で　5　ページからなる。

☐ この国際予備審査報告には、附属書類、つまり補正されて、この報告の基礎とされた及び／又はこの国際予備審査機関に対してした訂正を含む明細書、請求の範囲及び／又は図面も添付されている。
（ＰＣＴ規則70.16及びＰＣＴ実施細則第６０７号参照）
この附属書類は、全部で＿＿＿＿＿＿＿＿ページである。

３．　この国際予備審査報告は、次の内容を含む。

I ☒ 国際予備審査報告の基礎

II ☐ 優先権

III ☐ 新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての国際予備審査報告の不作成

IV ☒ 発明の単一性の欠如

V ☒ ＰＣＴ３５条(2)に規定する新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての見解、それを裏付けるための文献及び説明

VI ☐ ある種の引用文献

VII ☐ 国際出願の不備

VIII ☐ 国際出願に対する意見

国際予備審査の請求書を受理した日　１９．１１．２００３	国際予備審査報告を作成した日　０１．０７．２００４	
名称及びあて先 日本国特許庁（ＩＰＥＡ／ＪＰ） 郵便番号１００－８９１５ 東京都千代田区霞が関三丁目４番３号	特許庁審査官（権限のある職員） 榊原　貴子 電話番号　０３－３５８１－１１０１　内線　３４０２	４Ｃ　９４４４

様式ＰＣＴ／ＩＰＥＡ／４０９（表紙）（１９９８年７月）

BEST AVAILABLE COPY

国際予備審査報告

国際出願番号　ＰＣＴ／ＪＰ０３／１３１５２

Ⅰ．　国際予備審査報告の基礎

1．　この国際予備審査報告は下記の出願書類に基づいて作成された。（法第６条（ＰＣＴ１４条）の規定に基づく命令に応答するために提出された差し替え用紙は、この報告書において「出願時」とし、本報告書には添付しない。ＰＣＴ規則70.16, 70.17）

☒ 出願時の国際出願書類

☐ 明細書　第 ＿＿＿＿＿＿＿＿ ページ、出願時に提出されたもの
明細書　第 ＿＿＿＿＿＿＿＿ ページ、国際予備審査の請求書と共に提出されたもの
明細書　第 ＿＿＿＿＿＿＿＿ ページ、＿＿＿＿＿＿＿＿ 付の書簡と共に提出されたもの

☐ 請求の範囲　第 ＿＿＿＿＿＿＿＿ 項、出願時に提出されたもの
請求の範囲　第 ＿＿＿＿＿＿＿＿ 項、ＰＣＴ１９条の規定に基づき補正されたもの
請求の範囲　第 ＿＿＿＿＿＿＿＿ 項、国際予備審査の請求書と共に提出されたもの
請求の範囲　第 ＿＿＿＿＿＿＿＿ 項、＿＿＿＿＿＿＿＿ 付の書簡と共に提出されたもの

☐ 図面　第 ＿＿＿＿＿＿＿＿ ページ／図、出願時に提出されたもの
図面　第 ＿＿＿＿＿＿＿＿ ページ／図、国際予備審査の請求書と共に提出されたもの
図面　第 ＿＿＿＿＿＿＿＿ ページ／図、＿＿＿＿＿＿＿＿ 付の書簡と共に提出されたもの

☐ 明細書の配列表の部分　第 ＿＿＿＿＿＿＿＿ ページ、出願時に提出されたもの
明細書の配列表の部分　第 ＿＿＿＿＿＿＿＿ ページ、国際予備審査の請求書と共に提出されたもの
明細書の配列表の部分　第 ＿＿＿＿＿＿＿＿ ページ、＿＿＿＿＿＿＿＿ 付の書簡と共に提出されたもの

2．　上記の出願書類の言語は、下記に示す場合を除くほか、この国際出願の言語である。

上記の書類は、下記の言語である＿＿＿＿＿＿＿＿ 語である。

☐ 国際調査のために提出されたＰＣＴ規則23.1(b)にいう翻訳文の言語
☐ ＰＣＴ規則48.3(b)にいう国際公開の言語
☐ 国際予備審査のために提出されたＰＣＴ規則55.2または55.3にいう翻訳文の言語

3．　この国際出願は、ヌクレオチド又はアミノ酸配列を含んでおり、次の配列表に基づき国際予備審査報告を行った。

☐ この国際出願に含まれる書面による配列表
☐ この国際出願と共に提出された磁気ディスクによる配列表
☐ 出願後に、この国際予備審査（または調査）機関に提出された書面による配列表
☐ 出願後に、この国際予備審査（または調査）機関に提出された磁気ディスクによる配列表
☐ 出願後に提出した書面による配列表が出願時における国際出願の開示の範囲を超える事項を含まない旨の陳述書の提出があった
☐ 書面による配列表に記載した配列と磁気ディスクによる配列表に記録した配列が同一である旨の陳述書の提出があった。

4．　補正により、下記の書類が削除された。
☐ 明細書　第 ＿＿＿＿＿＿＿＿ ページ
☐ 請求の範囲　第 ＿＿＿＿＿＿＿＿ 項
☐ 図面　図面の第 ＿＿＿＿＿＿＿＿ ページ／図

5．☐ この国際予備審査報告は、補充欄に示したように、補正が出願時における開示の範囲を超えてされたものと認められるので、その補正がされなかったものとして作成した。（ＰＣＴ規則70.2(c)　この補正を含む差し替え用紙は上記１．における判断の際に考慮しなければならず、本報告に添付する。）

BEST AVAILABLE COPY

国際予備審査報告

国際出願番号　ＰＣＴ／ＪＰ０３／１３１５２

Ⅳ．　発明の単一性の欠如

１．　請求の範囲の減縮又は追加手数料の納付の求めに対して、出願人は、

☐ 請求の範囲を減縮した。

☒ 追加手数料を納付した。

☐ 追加手数料の納付と共に異議を申立てた。

☐ 請求の範囲の減縮も、追加手数料の納付もしなかった。

２．☐ 国際予備審査機関は、次の理由により発明の単一性の要件を満たしていないと判断したが、ＰＣＴ規則68.1の規定に従い、請求の範囲の減縮及び追加手数料の納付を出願人に求めないこととした。

３．　国際予備審査機関は、ＰＣＴ規則13.1、13.2及び13.3に規定する発明の単一性を次のように判断する。

☐ 満足する。

☒ 以下の理由により満足しない。

請求の範囲１－２０に記載された発明は「無毒性塩基とプロトンポンプインヒビター（ＰＰＩ）作用を持つ非晶形のベンズイミダゾール系化合物とを含有する安定な固形製剤」に関するものである。

請求の範囲２１－２２に記載された発明は「特定の包装形態にすることを特徴とする非晶形のＰＰＩ作用をもつベンズイミダゾール系化合物を含有する安定な固形製剤の製造方法」に関するものである。

請求の範囲２３－２６に記載された発明は「特定の工程を含有することを特徴とする非晶質ランソプラゾール光学活性体（Ｒ体）の製造法」に関するものである。

これらは、一の発明であるとも、単一の一般的発明概念を形成するように関連している一群の発明であるとも認められない。

４．　したがって、この国際予備審査報告書を作成するに際して、国際出願の次の部分を、国際予備審査の対象にした。

☒ すべての部分

☐ 請求の範囲 _____ に関する部分

様式ＰＣＴ／ＩＰＥＡ／４０９（第Ⅳ欄）（１９９８年７月）

BEST AVAILABLE COPY

国際予備審査報告

国際出願番号　ＰＣＴ／ＪＰ０３／１３１５２

Ⅴ．　新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての法第１２条（ＰＣＴ３５条(2)）に定める見解、それを裏付ける文献及び説明

１．　見解

新規性（Ｎ）	請求の範囲	１－２６	有
	請求の範囲		無
進歩性（ＩＳ）	請求の範囲	２３－２６	有
	請求の範囲	１－２２	無
産業上の利用可能性（ＩＡ）	請求の範囲	１－２６	有
	請求の範囲		無

２．　文献及び説明（ＰＣＴ規則70.7）

文献
１．EP 423748 A1 (TAKEDA CHEMICAL INDUSTRIES, LTD.), 1991.24.04
２．EP 496437 A2 (AKTLEBOLAGET HASSLE), 1992.07.29
３．EP 1004305 A1 (EISAI CO.,LTD.), 2000.05.31
４．EP 248634 A2 (NIPPON CHEMIPHAR CO.,LTD.), 1987.12.09
５．JP 2001-39975 A (エーザイ株式会社), 2001.02.13
６．EP 224249 A1 (SYNTEX(U.S.A.)INC), 1987.06.03
７．WO 00/78745 A2 (TAKEDA CHEMICAL INDUSTRIES, LTD.), 2000.12.28
８．EP 1191025 A1 (TAKEDA CHEMICAL INDUSTRIES, LTD.), 2002.03.27
９．JP 11-322605 A (ポーラ化成工業株式会社), 1999.11.24

説明
１．請求の範囲１、８－９に記載された発明は、文献１－６により進歩性を有さない。
安定化された製剤として、文献（１－３）には、ランソプラゾール（文献３）等のベンズイミダゾール系化合物と、炭酸マグネシウム（文献１－２）、水酸化マグネシウム（文献１－２）、炭酸ナトリウム（文献２－３）等の塩基性無機塩とからなる製剤が記載されている。
また、安定化された製剤として、文献４（特許請求の範囲14-23）には、ベンズイミダゾール系化合物と塩基性物質とからなる製剤が記載されている。
本願の請求の範囲１、８－９に記載された発明は、ベンズイミダゾール系化合物が非晶質である点で、文献１－４記載のものと相違する。
しかしながら、文献５には、ラベプラゾール、ランソプラゾール等のベンズイミダゾール系のスルホキシド誘導体について、従来、非晶質あるいは非結晶性固体（粉末）として製造されてきたことが記載されているから、文献１－４記載のベンズイミダゾール系化合物として非晶形のものを用いて製剤を製造することは、当業者にとって容易である。
また、文献４（表１参照）には、非晶質のベンズイミダゾール系化合物が安定であることが、文献６（要約）には、非晶質のベンズイミダゾール系化合物の溶解性、有効性が結晶性のものよりも高いことも記載されており、文献１－４記載のベンズイミダゾール系化合物として非晶形のものを用いることは、当業者にとって容易である。

（続葉有）

BEST AVAILABLE COPY

補充欄（いずれかの欄の大きさが足りない場合に使用すること）

第　Ｖ　欄の続き

２．請求の範囲１－９に記載された発明は、文献１－４、７－８により進歩性を有さない。
本願の請求の範囲１－９に記載された発明は、ベンズイミダゾール系化合物がＲ体あるいはＳ体の非晶質ランソプラゾールを含む、光学活性体の非晶質である点で、文献１－４記載のものと相違する。
しかしながら、例えば文献７－８に記載されたＲ体（＋）、Ｓ体（－）の非晶質ランソプラゾールのように、光学活性体の非晶質ベンズイミダゾール系化合物は公知であり、文献１－４記載のベンズイミダゾール系化合物としてＲ体あるいはＳ体の非晶質ランソプラゾールを含む、光学活性体の非晶形のものを用いて製剤を製造することは、当業者にとって容易である。

３．請求の範囲１０－１３、１９－２０に記載された発明は、文献１－８により進歩性を有さない。
文献１（第８頁第３４－３５行）には、錠剤等を腸溶性、持続放出性被膜層で被覆することが記載されている。
また、中間被覆層を設けることも、当業者が必要に応じて適宜なし得ることである。

４．請求の範囲１４－１８に記載された発明は、文献１－８により進歩性を有さない。
文献１－４記載の塩基性無機塩を２種以上用いることは、当業者が必要に応じて適宜なし得ることである。
加えて、請求の範囲１４－１８に記載された発明は、文献１－８から予測できない格別の効果を奏するものとも認められない。

５．請求の範囲２１－２２に記載された発明は、文献１－９により進歩性を有さない。　例えば文献９に記載されているように、窒素ガス置換包装、脱酸素剤を用いた包装等は製剤を安定化する手段として周知である。

６．請求の範囲２３－２６に記載された発明は、新規性及び進歩性を有する。
国際調査報告に引用されたいずれの文献にも、ランソプラゾール光学活性体の含水結晶を２０～１００℃に保持することを特徴とする非晶形ランソプラゾール光学活性体の製造方法は記載されておらず、その示唆もない。

７．請求の範囲１－２６に記載された発明は、産業上の利用可能性を有する。

BEST AVAILABLE COPY